

Анальгетическая активность соединения **5** по методу «уксуснокислых корчей» составляет $ED_{50} = 0,047 \pm 0,005$ мг/кг, при низкой токсичности $LD_{50} > 2\,000$ мг/кг. Для сравнения ED_{50} диклофенака натрия – 10,0 мг/кг, трамадола – 10-25 мг/кг, фентанила (сильнейшего опиоида) – 0,1 мг/кг.

Вероятный механизм действия: антагонист B_1 и B_2 рецепторов брадикинина – одного из важнейших медиаторов боли и воспаления.

Таким образом, нами создано инновационное соединение – высокоактивный анальгетик нового типа с низкой токсичностью, неопиоидного типа действия и не проявляющий психотропных свойств в дозах до 2 000 мг/кг с высоким терапевтическим индексом $ED_{50}/LD_{50} > 40\,000$. В настоящее время новый анальгетик проходит доклинические испытания на базе ООО «Ифар» (г. Томск).

Список литературы

1. Barnard E. A., Skolnick P., Olsen R. W. et al. // Pharmacol. Rev. 1998. Vol. 50. P. 291–312.
2. Evans B. E., Bock M. G., Rittle K. E. et al. // Proc. Natl. Acad. Sci. USA. 1986. Vol. 83. P. 4918–4922.
3. Wood M. R.; Kim J. J.; W. Han W. et al. // J. Med. Chem. 2003. Vol. 46. P. 1803–1806.
4. Dziadulewicz E. K., Brown M. C., Dunstan A. R et al. // Bioorg. Med. Chem. Lett. 1999. Vol. 9. P. 463–468.
5. Pavlovsky V. I., Tsymbalyuk O. V., Martynyuk V. S. et al. // Neurophysiology. 2013. Vol. 45. P. 427–432.
6. Павловский В. И., Ушаков И. Ю., Кабанова Т. А. и др. // Хим-фарм журн. 2015. Т. 49, № 9. С. 22–27.

УДК 547.85

Д. Н. Ляпустин, Е. Н. Уломский,
В. Л. Русинов

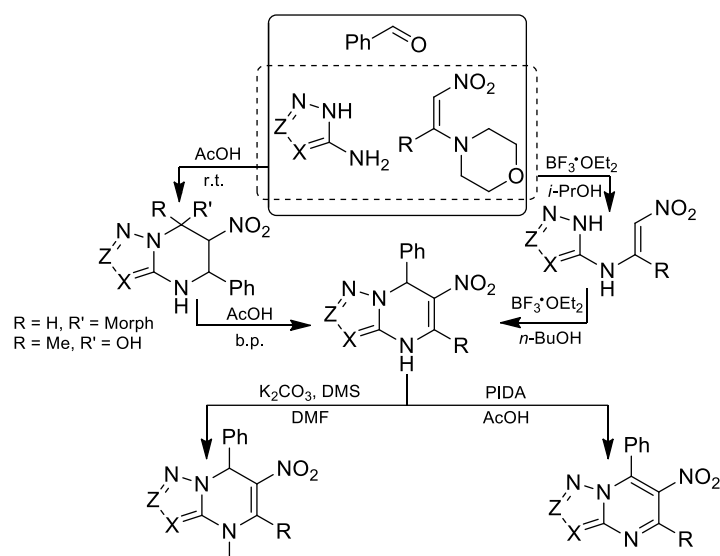
¹Уральский федеральный университет
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19,
lyapustin.danil@yandex.ru

4,7-ДИГИДРО-6-НИТРОАЗОЛО[1,5-*a*]ПИРИМИДИНЫ: МЕХАНИЗМЫ ОБРАЗОВАНИЯ И ХИМИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА*

Ключевые слова: мультикомпонентные реакции, нитросинтоны, механизм реакции, азолазины.

На сегодняшний день азотсодержащие гетероциклические соединения заслуженно заостряют на себе внимание многих химиков вследствие их фотофизических, биологических и физико-химических свойств. Нитросодержащие азолопиримидины зарекомендовали себя как противовирусные и противосептические средства. Тем не менее, методы их синтеза ограничены, а синтетические возможности этих методов исчерпываются. В данной работе мы хотим продемонстрировать новый подход к синтезу нитросодержащих азоло[1,5-*a*]пиримидинов путем проведения мультикомпонентных реакций.

Полученные таким образом 4,7-дигидроазоло[1,5-*a*]пиримидины могут быть окислены либо проалкилированы, что может привести к более применимым производным.



* Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ 20-03-00814.

УДК 547.745+547.892

А. А. Масливец, А. Н. Масливец

Пермский государственный национальный исследовательский университет,
614990, Россия, г. Пермь, ул. Букирева, 15,
koh2@psu.ru

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ ПИРРОЛОБЕНЗОКСАЗЕПИНТРИОНОВ С НУКЛЕОФИЛЬНЫМИ РЕАГЕНТАМИ

Ключевые слова: гетарено[*e*]пиррол-2,3-дионы, пирроло[1,2-*c*][4,1]бензоксазепин-1,2,4(6*H*)-трионы, 4-диоксобутанамиды, пирролидин-2,3-дионы.